

(19) 世界知的所有権機関  
国際事務局(43) 国際公開日  
2005年6月16日 (6.06.2005)

PCT

(10) 国際公開番号  
WO 2005/054213 A1(51) 国際特許分類: C07D 261/08, 261/20,  
261/18, 413/04, 417/12, A61K 31/42, 31/5377, 31/423,  
31/5395, 31/4245, 31/5377, 31/502, 31/536, 31/435,  
31/428, 31/427, 31/4427, 31/501, 31/506, A61P 43/00,  
3/06, 3/10, 3/04, 9/10, 9/12, 29/00, 37/08, 1/04, 19/02,  
1/18, 17/06, 17/04, 19/10, 15/00, 35/00, 25/28, 25/16

(21) 国際出願番号: PCT/JP2004/017706

(22) 国際出願日: 2004年11月29日 (29.11.2004)

(25) 国際出願の言語: 日本語

(26) 国際公開の言語: 日本語

(30) 優先権データ:  
特願2003-403274 2003年12月2日 (02.12.2003) JP  
特願2004-121635 2004年4月16日 (16.04.2004) JP  
特願2004-167941 2004年6月7日 (07.06.2004) JP  
特願2004-316251  
2004年10月29日 (29.10.2004) JP(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 塩野義  
製薬株式会社 (SHIONOGI & CO., LTD.) [JP/JP]; 〒  
5410045 大阪府大阪市中央区道修町3丁目1番8号  
Osaka (JP).

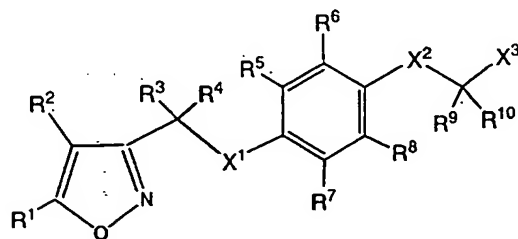
(72) 発明者: および

(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 福井 喜一  
(FUKUI, Yoshikazu) [JP/JP]; 〒5530002 大阪府大阪市  
福島区鷺洲5丁目12番4号 塩野義製薬株式会社  
内 Osaka (JP). 笹谷 隆司 (SASATANI, Takashi) [JP/JP];  
〒5530002 大阪府大阪市福島区鷺洲5丁目12番  
4号 塩野義製薬株式会社内 Osaka (JP). 松村 謙一  
(MATSUMURA, Ken-ichi) [JP/JP]; 〒5530002 大阪府  
大阪市福島区鷺洲5丁目12番4号 塩野義製薬株  
式会社内 Osaka (JP). 石塚 夏樹 (ISHIZUKA, Natsuki)  
[JP/JP]; 〒5530002 大阪府大阪市福島区鷺洲5丁目  
12番4号 塩野義製薬株式会社内 Osaka (JP). 矢野  
利定 (YANO, Toshisada) [JP/JP]; 〒5530002 大阪府大  
阪市福島区鷺洲5丁目12番4号 塩野義製薬株  
式会社内 Osaka (JP). 神田 泰彦 (KANDA, Yasuhiko)  
[JP/JP]; 〒5530002 大阪府大阪市福島区鷺洲5丁目  
12番4号 塩野義製薬株式会社内 Osaka (JP). 長命  
信雄 (CHOMEI, Nobuo) [JP/JP]; 〒5530002 大阪府大  
阪市福島区鷺洲5丁目12番4号 塩野義製薬株式  
会社内 Osaka (JP).(74) 代理人: 山内秀晃, 外(YAMAUCHI, Hideaki et al.); 〒  
5530002 大阪府大阪市福島区鷺洲5丁目12番4号  
塩野義製薬株式会社 知的財産部 Osaka (JP).

(続葉有)

(54) Title: ISOXAZOLE DERIVATIVE HAVING AGONISTIC ACTIVITY AGAINST PEROXISOME PROLIFERATOR-ACTI-  
VATED RECEPTOR

(54) 発明の名称: ペルオキシソーム増殖活性化受容体アゴニスト活性を有するイソキサゾール誘導体



(I)

(57) Abstract: Compounds represented  
by the formula (I) (wherein R<sup>1</sup> to R<sup>10</sup>  
each independently is hydrogen, halogeno,  
optionally substituted lower alkyl, etc.;  
X<sup>1</sup> is -O-, -S-, -NR<sup>11</sup>, (wherein R<sup>11</sup> is  
hydrogen, lower alkyl, etc.), -CR<sup>12</sup>R<sup>13</sup>CO-,  
-(CR<sup>12</sup>R<sup>13</sup>)<sub>m</sub>O-, or -O(CR<sup>12</sup>R<sup>13</sup>)<sub>m</sub>- (wherein  
R<sup>12</sup> and R<sup>13</sup> each independently is hydrogen  
or lower alkyl and m is an integer of 1 to  
3), etc.; X<sup>2</sup> is a single bond, -O-, -S-, -NR<sup>14</sup>,  
(wherein R<sup>14</sup> is hydrogen, lower alkyl, etc.,  
or -CR<sup>15</sup>R<sup>16</sup>, (wherein R<sup>15</sup> and  
R<sup>16</sup> each independently is hydrogen or lower alkyl, provided that R<sup>15</sup> may be bonded to R<sup>6</sup> or R<sup>10</sup> to form a ring in cooperation  
with the adjacent carbon atoms and R<sup>16</sup> and R<sup>9</sup> in combination may form a bond); and X<sup>3</sup> is COOR<sup>17</sup>, C(=NR<sup>17</sup>)NR<sup>18</sup>OR<sup>19</sup>, etc.),  
pharmaceutically acceptable salts of the compounds, or solvates of any of these.provided that R<sup>14</sup> may be bonded to R<sup>6</sup> to form a ring in cooperation with the adjacent atoms), or -CR<sup>15</sup>R<sup>16</sup>. (wherein R<sup>15</sup> and  
R<sup>16</sup> each independently is hydrogen or lower alkyl, provided that R<sup>15</sup> may be bonded to R<sup>6</sup> or R<sup>10</sup> to form a ring in cooperation  
with the adjacent carbon atoms and R<sup>16</sup> and R<sup>9</sup> in combination may form a bond); and X<sup>3</sup> is COOR<sup>17</sup>, C(=NR<sup>17</sup>)NR<sup>18</sup>OR<sup>19</sup>, etc.),  
pharmaceutically acceptable salts of the compounds, or solvates of any of these.(57) 要約: 式 (I): 【化1】 (式中、R<sup>1</sup>~R<sup>10</sup>は各々独立して水素、ハロゲン、置換基を有していてもよい低級ア  
ルキル等であり、X<sup>1</sup>は-O-、-S-、-NR<sup>11</sup>- (ここでR<sup>11</sup>は水素または低級アルキル等)、-CR<sup>12</sup>R<sup>13</sup>CO-、  
-(CR<sup>12</sup>R<sup>13</sup>)<sub>m</sub>O-または-O(CR<sup>12</sup>R<sup>13</sup>)<sub>m</sub>- (ここでR<sup>12</sup>およびR<sup>13</sup>は各々独立して水素または低級ア  
ルキル等であり、mは1~3の整数)等であり、X<sup>2</sup>は単結合、-O-、-S-、-NR<sup>14</sup>- (ここでR<sup>14</sup>は水素または低級ア  
ルキル等、R<sup>14</sup>はR<sup>6</sup>と共に隣接する原子と一緒に環を形成してもよい) または-CR<sup>15</sup>R<sup>16</sup>- (こ  
こでR<sup>15</sup>およびR<sup>16</sup>は各々独立して水素または低級アルキル等であり、R<sup>15</sup>はR<sup>6</sup>またはR<sup>10</sup>と共に隣接する炭  
素原子と一緒に環を形成してもよく、R<sup>16</sup>はR<sup>9</sup>と一緒に環を形成してもよい) であり、X<sup>3</sup>は  
COOR<sup>17</sup>またはC(=NR<sup>17</sup>)NR<sup>18</sup>OR<sup>19</sup>等である) で示される化合物、それらの製薬上許容される塩また  
はそれらの溶媒和物。